COMPOSITION FOR EXTERNAL APPLICATION CONSISTING ESSENTIALLY OF A DEXTRIN FATTY ACID ESTER, A GLYCEROL FATTY **ACID ESTER AND AN OIL** □ <u>US5106625</u> Patent Number: 1992-04-21 Publication date: YAMAMOTO TOMOYUKI (JP); SHIGETA AKIRA (JP); MITSUNO YUICHIRO (JP) Inventor(s): KAO CORP (JP) Applicant(s): Requested Patent: DE4025040 Application Number: US19900564063 19900808 Priority Number(s): JP19890206546 19890809 A61K7/48 IPC Classification: A61K7/48N8K, A61K47/00R, A61K47/36, A61K7/02, A61K7/48C4K4, A61K7/48T EC Classification: CA2022851, FR2650835, JP2887485B2, JP3068505 Equivalents:

Abstract

An oily composition comprising a dextrin fatty acid ester, a glycerol fatty acid ester having a melting point of higher than 20 DEG C., and a liquid oil is disclosed. The oily compositions for external application are transparent or semi-transparent, and possess excellent extendibility, adhesive c apability, and retentivity on the skin. The compositions are useful for various oily cosmetics and oily medicines for external application.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

¹⁰ Off nl gungsschrift¹⁰ DE 4025040 A1

(5) Int. Cl. 5: A 61 K 7/02



PATENTAMT

 (2)
 Aktenzeichen:
 P 40 25 040.7

 (2)
 Anmeldetag:
 7. 8. 90

 (3)
 Offenlegungstag:
 14. 2. 91

③ Unionspriorität: ② ③ ③

09.08.89 JP P 206546/89

(7) Anmelder: Kao Corp., Tokio/Tokyo, JP

Wächtershäuser, G., Dipl.-Chem. Dr.rer.nat., Pat.-Anw., 8000 München (7) Erfinder:

Yamamoto, Tomoyuki; Shigeta, Akira, Tokio/Tokyo, JP; Mitsuno, Yuichiro, Sakura, Chiba, JP

(5) Ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung

Die vorliegende Erfindung betrifft eine ölige Zusammensetzung, umfassend einen Dextrinfettsäureester, einen Glycerinfettsäureester mit einem Schmelzpunkt von höher als 20°C, und ein flüssiges Öl. Die öligen Zusammensetzungen zur äußeren Anwendung sind transparent oder semitransparent und weisen hervorragende Auftragbarkeit, Haftfähigkeit und Beständigkeit auf der Haut auf. Die Zusammensetzungen sind nützlich für verschiedenartige ölige Kosmetika und ölige Medikamente zur äußeren Anwendung.

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft eine ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung, welche ein transparentes oder semitransparentes Erscheinungsbild aufweist und hervorragende Beständigkeit und Auftragbarkeit auf die Haut und Haftfähigkeit auf der Haut ermöglicht.

Ölige Zusammensetzungen zur äußeren Anwendung umfassen beispielsweise ölige Kosmetika, ölige Medikamente zur äußeren Anwendung und dergleichen. Typische Beispiele für ölige Kosmetika sind stickartige Kosmetika, z. B. Lippenstifte, Lippencremes, Grundierungsstifte, Pomadenstifte; stiftartige Kosmetika wie z. B. Augenbrauenstifte, Eyelinerstifte; und gepreßte Puder und ölige Kosmetika vom Kuchen-Typ, z. B. Grundierungen, Lidschatten, Rouges. Beispiele für ölige Medikamente zur äußeren Anwendung sind Salben und dergleichen.

Diese öligen Kosmetika werden herkömmlicherweise hergestellt durch Mischen fester Fette wie Carnaubawachs, Candelillawachs, Ceresin, mikrokristallines Wachs, hydrierte tierische oder pflanzliche Fette, Bienenwachs, Polyethylenwachs und dergleichen, mit Ölen wie Castoröl, Olivenöl, Jojobaöl, Squalen, verschiedene synthetische Ester, Silikonöl, flüssiges Paraffin und dergleichen, in welchen Puder wie Pigmente und dergleichen nach Bedarf dispergiert werden. Es gibt einige ölige Kosmetika, in welchen halbfeste Öle wie Vaseline und dergleichen, die Zwischencharakteristika von festen und flüssigen Ölen aufweisen, anstelle der obigen Bestandteile verwendet werden. Ölige Medikamente zur äußeren Anwendung werden herkömmlicherweise hergestellt durch Verkneten der pharmazeutischen Bestandteile in das gemischte System der obigen festen Fette und flüssigen Öle.

Die ölige Zusammensetzung, welche hergestellt wird aus einem gemischten System der obigen festen Fette und flüssigen Öle, weist aber eine Klümpchenstruktur auf, in welcher die Kristalle des festen Fettes aus dem Öl in flüssigem Zustand ausgefällt sind. Dieser Kristalltyp ist schwer kontrollierbar und nimmt an Größe zu. Deswegen weisen ölige Zusammensetzungen schlechte Transparenz auf und neigen zur Trübung. Zusätzlich müssen ölige Zusammensetzungen eine verhältnismäßig größere Menge von festen Fetten beinhalten zur Verbesserung der Formbeständigkeit. Solche Zusammensetzungen werden normalerweise hart, weisen eine schlechte Verstreichbarkeit auf der Haut auf und eine schlechte Haftfähigkeit, weil sie bei der Auftragung ihre einheitliche Struktur verlieren. Ein weiterer Nachteil dieser Verbindungen ist, daß die Beständigkeit der Zusammensetzung nach dem Auftragen auf die Haut abnimmt, weil die Viskosität der Verbindungen geringer wird.

Es ist daher Aufgabe der vorliegenden Erfindung, eine ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung zu schaffen, welche ein transparentes oder semitransparentes Erscheinungsbild und hervorragende Beständigkeit und Auftragbarkeit auf die Haut sowie Haftfähigkeit auf der Haut aufweist.

Die Erfinder haben ausführliche Studien durchgeführt und dabei festgestellt, daß eine ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung, welche ein transparentes oder semitransparentes Erscheinungsbild und hervorragende Beständigkeit und Auftragbarkeit auf die Haut sowie Haftfähigkeit auf der Haut aufweist, erhalten werden kann, indem man zwei Arten von spezifischen Fettsäureestern und Öle in flüssigem Zustand in einem spezifischen Verhältnis verarbeitet. Dieses Ergebnis hat zur vorliegenden Erfindung geführt.

Es ist eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, eine transparente oder semitransparente ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung zu schaffen, welche hervorragende Beständigkeit und Auftragbarkeit auf die Haut sowie Haftfähigkeit auf der Haut aufweist, welche umfaßt: (A) einen Dextrinfettsäureester, (B) einen Glycerinfettsäureester mit einem Schmelzpunkt von höher als 20°C, und (C) ein kosmetisch akzeptables Öl, welches bei 20°C flüssig ist.

In einer bevorzugten Ausführungsform der vorliegenden Erfindung ist der Dextrinfettsäureester (A) ein Ester von Dextrin mit einem durchschnittlichen Polymerisationsgrad von 10 bis 50 und einer Fettsäure mit 8 bis 24 Kohlenstoffatomen, der Glycerinfettsäureester (B) hat einen Schmelzpunkt von höher als 20°C und einen Fettsäurerest mit einem Gehalt an Kohlenstoffatomen von 8 bis 22, und das Gewichtsverhältnis von (A): (B) beträgt von 9:1 bis 4:6, und das Gesamtgewicht von (A) und (B) beträgt 2 bis 75 Gew.%.

Andere Aufgaben, Merkmale und Vorteile der Erfindung werden in der folgenden Beschreibung klarer

Die Dextrinfettsäureester, die in dieser Erfindung verwendet werden, stammen von öllöslichen Esterverbindungen und vorzugsweise von solchen Esterverbindungen von (1) einer Fettsäure mit 8 bis 24 Kohlenstoffatomen, stärker bevorzugt mit 14 bis 18 Kohlenstoffatomen, und (2) einem Oextrin mit einem durchschnittlichen Polymerisationsgrad von 10 bis 50, stärker bevorzugt von 20 bis 30. Ein bevorzugter Substitutionsgrad der Fettsäuren liegt bei nicht weniger als 1,0 pro Glucose-Einheit.

Beispiele für diese Dextrinfettsäureester sind Dextrinpalmitat, Dextrinstearat, Dextrinpalmitatstearat, Dextrinisopalmitat, Dextrinisostearat und dergleichen. Sie können einzeln oder als eine Mischung von einem oder mehreren derselben verwendet werden. Ein bevorzugter Dextrinfettsäureester, der im Handel erhältlich ist, ist Dextrinpalmitat (Leopal KL, hergestellt von Chiba Seifun Co., Ltd.).

Die in vorliegender Erfindung eingesetzten Glycerinfettsäureester haben einen Schmelzpunkt von höher als 20°C. Darunter sind Mono-, Di- oder Tri-glycerinfettsäureester mit einem Schmelzpunkt von höher als 30°C und einer Fettsäurerest-Kohlenstoffzahl von 8 bis 22 bevorzugt.

Bevorzugte Beispiele der Glycerinfettsäureester sind natürliche Öle und Fette, z. B. Kokosnußöl, Palmöl; Tripalmitat, Tristearat und Tribehenat von Glycerin; und dergleichen. Ein besonders bevorzugtes Beispiel ist Triglycerinfettsäureester, welcher hergestellt wurde aus zwei Behensäuren und einer Ölsäure (Japanisches offengelegtes Patent Nr. 21 0017/1986).

Das Gewichtsverhältnis von Dextrinfettsäureester und Glycerinfettsäureester, welches in der Zusammensetzung der vorliegenden Erfindung vorliegen muß, beträgt im allgemeinen von 9:1 bis 4:6 und bevorzugterweise von 8:2 bis 1:1. Das Verhältnis außerhalb des Bereichs von 9:1 bis 4:6 bewirkt einen verschlechternden Effekt auf die Charakteristika der Zusammensetzung. Zum Beispiel, wenn die Menge an Glycerinfettsäureester

niedriger ist als dieser Bereich, verringert sich die Beständigkeit der Zusammensetzung, während, wenn die Menge an Dextrinfettsäureester niedriger ist als dieser Bereich, sich die Transparenz der Zusammensetzung verschlechtert. Die Gesamtmenge an beiden in die Zusammensetzung einzuarbeitenden Fettsäureestern beträgt vorzugsweise 2 bis 75 Gew.-%, wobei 5 bis 50 Gew.-% bevorzugt ist. Eine Menge von weniger als 2 Gew.-% führt zu einer Verringerung der Haftfähigkeit und Beständigkeit der Zusammensetzung, während eine Menge von mehr als 75 Gew.-% sich ungünstig auf die Haftfähigkeit und Auftragbarkeit der Zusammensetzung auswirkt. Als in der Erfindung einzusetzende flüssige Öle können jedes Öl, welches bei 20° C flüssig ist, sowie alle auswirkt. Als in der Erfindung einzusetzende flüssige Öle können jedes Öl, welches bei 20° C flüssig ist, sowie alle üblicherweise für kosmetische Zusammensetzungen verwendeten Öle eingesetzt werden. Als Beispiel für diese üblicherweise für kosmetische Zusammensetzungen verwendeten Öle eingesetzt werden. Als Beispiel für diese üblicherweise für kosmetische Zusammensetzungen verwendeten Öle und Fette wie Olivenöl, Castoröl, Jojobaöl und dergleichen; natürliche tierische oder pflanzliche Öle und Fette wie Olivenöl, Castoröl, Jojobaöl und dergleichen; Silikonöle wie Dimethylpolysiloxan und dergleichen; und synthetische Ester wie Malat, Neopentylglycolat, Isopropylmyristat und dergleichen. Solche Öle werden in der Zusammensetzung der vorliegenden Erfindung vorzugsweise in einer Menge von 25 bis 98 Gew.-% eingesetzt, wobei 50 bis 95 Gew-% besonders bevorzugt sind.

Die Transparenz der Verbindung der vorliegenden Erfindung kann verbessert werden, indem man zusätzlich einen verzweigten Fettsäurecholesterylester zugibt, der z. B. in den Japanischen offengelegten Patenten Nr. 65 809/1981 und 1 407/1984 offenbart ist. Eine bevorzugte Menge des einzuarbeitenden verzweigten Fettsäurecholesterylesters beträgt 1 bis 75 Gew.-%, wobei 5 bis 50 Gew.-% besonders bevorzugt sind. Wasser oder wasserlöslicher mehrwertiger Alkohol kann, soweit erforderlich, in die Zusammensetzung der vorliegenden Erfindung eingearbeitet werden in einer Menge, daß die Transparenz der Zusammensetzung nicht ungünstig beeinflußt wird. Die wasserlöslichen mehrwertigen Alkohole, die erfindungsgemäß eingesetzt werden, haben zwei oder mehr Hydroxylgruppen in einem Molekül. Als Beispiele für die Alkohole seien Dipropylenglycol, 1,3-Butylenglycol, 1,4-Butylenglycol und dergleichen genannt. Beispiele für wasserlösliche mehrwertige Alkohole mit drei oder mehr Hydroxylgruppen sind Polyglycerine wie Glycerin, Diglycerin, Triglycerin, Tetraglycerin und dergleichen; Maltose, Maltit, Sucrose, Fructose, Xylit, Sorbit, Maltotriose, Threit, Erythrit und dergleichen.

Über die obigen wichtigen Komponenten hinaus, können nach Bedarf verschiedene bekannte Komponenten für die Zusammensetzungen zur äußeren Anwendung in die erfindungsgemäße ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung eingearbeitet werden. Solche Komponenten umfassen Antioxidantien, Puder, oberflächenaktive Mittel, Antiseptica, Parfums, Farbstoffe, Medikamente, Mittel zur Erzielung eines Kältegefühls, UV-Strahlungsabsorbiermittel und dergleichen.

Die erfindungsgemäße ölige Zusammensetzung kann verwendet werden als Ölphase für verschiedene Emulsionszusammensetzungen.

Im folgenden wird die Erfindung anhand von verschiedenen Beispielen erläutert, welche die Erfindung illustrieren, aber in keiner Weise einschränken.

Beispiel 1

Die Bestandteile jeder Zusammensetzung, die in Tabelle 1 aufgeführt sind, werden homogen bei Hitze gelöst und auf Zimmertemperatur abgekühlt. Man erhält die jeweiligen öligen Zusammensetzungen (d. h. Lippencremes).

Transparenz, Beständigkeit, Auftragbarkeit und Haftfähigkeit der einzelnen resultierenden öligen Zusammensetzungen wird entsprechend dem unten angegebenen Standard ermittelt. Fig. 1 zeigt die Ergebnisse.

Bewertungsstandard

Die Bewertung jeder Zusammensetzung erfolgt gemäß den folgenden Kriterien, wobei Vergleichsverbindung B als Standardwert gesetzt wird:

CCC: Normal, BBB: Gut, AAA: Sehr gut.

55

45

50

35

65

Tabelle 1

		gsgemäße		Vergleichs- zusammensetzung	
5	Zusamme 1 Gew%	ensetzung 2	3	A	В
Bestandteil Carnaubawachs Ceresin		-	-	4 4 5	<u>-</u> -
Candellilawachs Mikrokristallines Wach Glycerinmonopalmitat Ölsäuredibehensäuretr	iglycerid 5	10	- 5 10 20	4 - -	10 - - 10
Dextrinpalmitat (Leopal KL von Chiba S Dextrinstearat Flüssiges Paraffin	48	4 17	- 10 25	 33 50	- 80 -
Octyldodecylmyristat Cholesterylstearat	32 —	65 —	30	-	-
Bewertung Transparenz Beständigkeit ²⁵ Verstreichbarkeit Haftfähigkeit	BBB BBB BBB BBB	BBB-AAA BBB BBB-AAA BBB	AAA AAA AAA	CCC CCC CCC	CC(CC(CC(

Beispiel 2

Die vier unten aufgeführten Komponenten werden unter Erhitzen gelöst und homogen vermischt. Die Mischung wird auf Raumtemperatur abgekühlt. Man erhält eine ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung (d. h. ein Antiphlogisticum). In diesem Beispiel werden verschiedene ölige Zusammensetzungen zur äußeren Anwendung hergestellt, wobei als Öl-Komponente Squalen, flüssiges Paraffin mit mittlerer Viskosität, Neopentylglycoldicaprat, Isopropylmyristat (IPM), 2-Ethylhexansäuretriglycerid, Olivenöl, Jojobaöl, Myristinsäureisostearylsäurediglycerid bzw. Diisostearylmalat eingesetzt werden.

Bestandteile

40	Dextrinpalmitat (Leopal KL)	12 g
	Ölsäuredibehensäuretriglycerid	3 g
	1-Menthol	1 g
	Öl	84 g
	Gesamt	100 g
45		

50

55

60

65

Jede ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung unter Einsatz jeweils der obigen Ölbestandteile weist ausgezeichnete Transparenz, Beständigkeit, Auftragbarkeit und Haftfähigkeit auf.

Beispiel 3

Bestandteile jeder Zusammensetzung, die in Tabelle 2 angegeben sind, werden auf 100°C erhitzt und homogen vermischt. Die Mischung wird auf Raumtemperatur abgekühlt. Man erhält ein Gesichtspuder. Die Ergebnisse sind in Tabelle 2 angegeben.

Tabelle 2

Verbindung	Erfindungs Zusammen		
	4 Gew%	5	
Ölsäuredibehensäuretriglycerid	1	12	
Dextrinmyristat	9	8	
Titanoxid	5	5	
Sericit	25	25	
Talkum	5	5	
Kaolin	10	10	
Squalen	15	5	
Methylphenylpolysiloxan	5	5	
Olivenöl	15	15	
Jojobaöl	5	5	
Isopropylmyristat	5	5	
130h: obj			

Die erhaltenen öligen Grundierungen zeigen ausgezeichnete Beständigkeit, Auftragbarkeit und Haftfähigkeit.

Beispiel 4

Die unten aufgeführten Bestandteile werden auf die gleiche Weise wie in Beispiel 3 beschrieben verarbeitet. 25 Man erhält eine ölige Wimperntusche.

Bestandteile

	Gew%	30
Ölsäurebehensäuretriglycerid Dextrinpalmitat Titanoxid Sericit Talkum	6 5 5 2 1	35
Pigment Flüssiges Paraffin Olivenöl Gesamt	2 39 40 100	40

Die erhaltene ölige Wimperntusche weist ausgezeichnete Beständigkeit, Verstreichbarkeit und Haftfähigkeit auf.

Die erfindungsgemäßen öligen Zusammensetzungen zur äußeren Anwendung sind transparent oder semitransparent und weisen ausgezeichnete Auftragbarkeit, Haftfähigkeit und Beständigkeit auf. Die Verbindungen sind daher geeignet für verschiedene ölige Kosmetika und ölige Medikamente zur äußeren Anwendung.

Patentansprüche

- 1. Ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung, umfassend (A) einen Dextrinfettsäureester, (B) einen Glycerinfettsäureester, der einen Schmelzpunkt von höher als 20°C aufweist, und (C) ein kosmetisch akzeptables Öl, welches bei 20°C flüssig ist.
- 2. Ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Dextrinfettsäureester (A) ein Ester von einem Dextrin mit einem mittleren Polymerisationsgrad von 10 bis 50 und einer Fettsäure mit 8 bis 24 Kohlenstoffatomen ist.
- 3. Ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Glycerinfettsäureester (B) einen Schmelzpunkt von höher als 20°C und einen Fettsäurerest mit 8 bis 22 Kohlenstoffatomen hat.
- 4. Ölige Zusammensetzung zur äußeren Anwendung gemäß Anspruch 1, 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, daß das Gewichtsverhältnis von (A): (B) von 9:1 bis 4:6 beträgt und das gesamte Gewicht von (A) und (B) 2 bis 75 Gew.-% beträgt.

65

50

– Leerseite –